

**Sughrue**

SUGHRUE MION ZINN MACPEAK & SEAS, PLLC

May 4, 2001

PROX PATENT APPLICATION

Commissioner for Patents  
Washington, D.C. 20231

Re: Application of Kenichiro SHIROYAMA, Kenya ISHIDA, Hideaki OHTA, and  
Toshimitsu HAGIWARA  
CLEAR AQUEOUS CERAMIDE COMPOSITION  
Our Ref. Q64175

Dear Sir:

Attached hereto is the application identified above including thirty-eight (38) sheets of the specification, including the claims and abstract, Information Disclosure Statement, PTO Form 1449 with references, PTO Form 1595, executed Declaration and Power of Attorney and Assignment.

The Government filing fee is calculated as follows:

Total claims	<u>11</u>	-	20	=		x	\$18.00	=	<u>\$0.00</u>
Independent claims	<u>3</u>	-	3	=		x	\$80.00	=	<u>\$0.00</u>
Base Fee									\$710.00
<b>TOTAL FILING FEE</b>									<b>\$710.00</b>
Recordation of Assignment									\$40.00
<b>TOTAL FEE</b>									<b>\$750.00</b>

Checks for the statutory filing fee of \$710.00 and Assignment recordation fee of \$40.00 are attached. You are also directed and authorized to charge or credit any difference or overpayment to Deposit Account No. 19-4880. The Commissioner is hereby authorized to charge any fees under 37 C.F.R. §§ 1.16 and 1.17 and any petitions for extension of time under 37 C.F.R. § 1.136 which may be required during the entire pendency of the application to Deposit Account No. 19-4880. A duplicate copy of this transmittal letter is attached.

Priority is claimed from May 11, 2000, based on JP Application No. 2000-138072. The priority document is enclosed herewith.

Respectfully submitted,  
SUGHRUE, MION, ZINN,  
MACPEAK & SEAS, PLLC  
Attorneys for Applicant

By: Mark Boland  
Mark Boland  
Registration No. 32,197

MXB:ob

日 本 国 特 許 庁  
PATENT OFFICE  
JAPANESE GOVERNMENT

別紙添付の書類に記載されている事項は下記の出願書類に記載されている事項と同一であることを証明する。

This is to certify that the annexed is a true copy of the following application as filed with this Office.

出 願 年 月 日

Date of Application:

2000年 5月11日

出 願 番 号

Application Number:

特願2000-138072

出 願 人

Applicant(s):

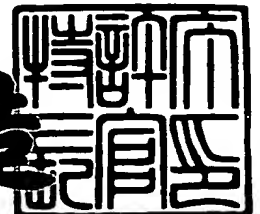
高砂香料工業株式会社



2001年 4月13日

特許庁長官  
Commissioner,  
Patent Office

及川耕造



出証番号 出証特2001-3030245

【書類名】 特許願

【整理番号】 K00013

【あて先】 特許庁長官殿

【国際特許分類】 A61K 7/00

【発明者】

【住所又は居所】 神奈川県平塚市西八幡一丁目4番11号 高砂香料工業株式会社 総合研究所内

【氏名】 城山 健一郎

【発明者】

【住所又は居所】 神奈川県平塚市西八幡一丁目4番11号 高砂香料工業株式会社 総合研究所内

【氏名】 石田 賢哉

【発明者】

【住所又は居所】 神奈川県平塚市西八幡一丁目4番11号 高砂香料工業株式会社 総合研究所内

【氏名】 太田 英明

【発明者】

【住所又は居所】 神奈川県平塚市西八幡一丁目4番11号 高砂香料工業株式会社 総合研究所内

【氏名】 萩原 利光

【特許出願人】

【識別番号】 000169466

【氏名又は名称】 高砂香料工業株式会社

【代表者】 新村 嘉也

【代理人】

【識別番号】 100108350

【弁理士】

【氏名又は名称】 鐘尾 宏紀

【選任した代理人】

【識別番号】 100091948

【弁理士】

【氏名又は名称】 野口 武男

【手数料の表示】

【予納台帳番号】 045447

【納付金額】 21,000円

【提出物件の目録】

【物件名】 明細書 1

【物件名】 要約書 1

【包括委任状番号】 9721629

【プルーフの要否】 要

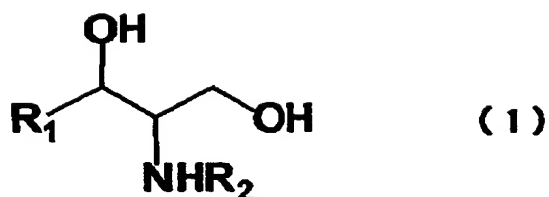
【書類名】 明細書

【発明の名称】 水性透明組成物

【特許請求の範囲】

【請求項 1】 (A) 式 1 :

【化 1】

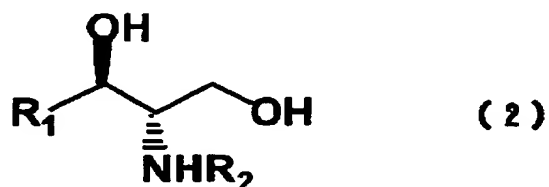


(式中、 $\text{R}_1$  は炭素数 9 ～ 17 の炭化水素基を表し、 $\text{R}_2$  は炭素数 2 ～ 30 の水酸基を有してもよいアシル基を表す。)

で表されるセラミド類、(B) 炭素数 12 ～ 24 の長鎖脂肪酸、(C) 非イオン界面活性剤、および (D) 水からなり、式 1 で表されるセラミド類を 1.0 ～ 5.0 重量%含有することを特徴とする水性透明組成物。

【請求項 2】 セラミド類が、式 2 :

【化 2】



(式中、 $\text{R}_1$  は炭素数 9 ～ 17 の炭化水素基を表し、 $\text{R}_2$  は炭素数 2 ～ 30 の水酸基を有してもよいアシル基を表す。)

で表される光学活性な天然型セラミド類であることを特徴とする請求項 1 記載の水性透明組成物。

【請求項 3】 長鎖脂肪酸がイソステアリン酸およびオレイン酸から選ばれた少

なくとも 1 種であることを特徴とする請求項 1 または 2 記載の水性透明組成物。

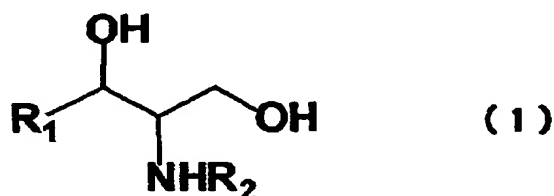
【請求項 4】非イオン界面活性剤がポリオキシエチレン硬化ヒマシ油類であることを特徴とする請求項 1 ～ 3 のいずれかに記載の水性透明組成物。

【請求項 5】ステロール類および多価アルコール類からなる群から選ばれた少なくとも一種の化合物がさらに配合されていることを特徴とする請求項 1 ～ 4 のいずれかに記載の水性透明組成物。

【請求項 6】ステロール類がコレステロールであることを特徴とする請求項 5 記載の水性透明組成物。

【請求項 7】(A) 式 1 :

【化 3】



(式中、 $\text{R}_1$  は炭素数 9 ～ 17 の炭化水素基を表し、 $\text{R}_2$  は炭素数 2 ～ 30 の水酸基を有してもよいアシル基を表す。)

で表されるセラミド類、(B) 炭素数 12 ～ 24 の長鎖脂肪酸、および (C) 非イオン界面活性剤を含む脂質組成物に水を加えることを特徴とする、式 1 で表されるセラミド類を 1.0 ～ 5.0 重量%含有する水性透明組成物の調製方法。

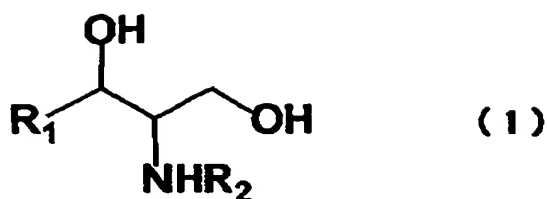
【請求項 8】請求項 1 ～ 6 のいずれかに記載の水性透明組成物を 0.01 ～ 100 重量%含有することを特徴とする皮膚化粧品。

【請求項 9】請求項 1 ～ 6 のいずれかに記載の水性透明組成物を 0.01 ～ 50 重量%含有することを特徴とする毛髪用化粧品。

【請求項 10】請求項 1 ～ 6 のいずれかに記載の水性透明組成物を 0.001 ～ 50 重量%含有することを特徴とする浴用剤。

【請求項 11】(A) 式 1 :

## 【化 4】



(式中、 $\text{R}_1$  は炭素数 9～17 の炭化水素基を表し、 $\text{R}_2$  は炭素数 2～30 の水酸基を有してもよいアシル基を表す。)

で表されるセラミド類、(B) 炭素数 12～24 の長鎖脂肪酸、および (C) 非イオン界面活性剤を含み、上記セラミド類 (A) と上記長鎖脂肪酸 (B) の重量比が  $A : B = 20 : 1 \sim 1 : 3$  であり、上記セラミド類 (A) と非イオン界面活性剤 (C) の重量比が  $A : C = 1 : 1 \sim 1 : 10$  であることを特徴とする、水性透明組成物を調製するために有用な脂質組成物。

## 【発明の詳細な説明】

## 【0001】

## 【発明の属する技術分野】

本発明は、セラミド類を含有する水性透明組成物、その調製方法、セラミド類を含有する水性透明組成物を含有する皮膚化粧料、毛髪用化粧料および浴用剤並びにセラミド類を含有する水性透明組成物を調製するために有用な脂質組成物に関する。

## 【0002】

## 【従来の技術】

皮膚は外界からの微生物、化学物質、紫外線等の生物、化学、物理的な侵襲を避けると共に水分等の生体必須成分の損失を防ぐバリアー膜として非常に重要な機能を営んでいる。バリアー膜として機能しているのは表皮最外層に位置する厚さ約  $20 \mu\text{m}$  の角質層であり、レンガ状に積み重なった角質細胞を細胞間脂質がモルタルの様に繋ぎ止める形で強固なバリアー膜を形成している。セラミドはこの角質細胞間脂質中の鍵成分として脂質バリアーを構築し、皮膚を柔軟でみずみ

ずしく保つための重要な役割を果たしていることが知られている (Downing D.T., et al., J.Lipid.Res.,24, 759 (1983)、Downing D.T., et al., J.Invest.Dermat.,84, 410 (1985))。そして、荒れ肌、乾燥肌、アトピー性皮膚炎の患者の皮膚には、これらの角質細胞間脂質中におけるセラミドの含有量が、健常な人の皮膚と比較して著しく低下していることが明らかとなっている。このセラミドを含む細胞間脂質を、荒れた肌、荒れた皮膚に補うことにより、肌荒れの改善を図ろうという試みは従来からなされており、例えば、セラミドあるいはセラミドを含む細胞間脂質を含有する混合物を調製し、皮膚に薄く塗るなど種々の方法が採られている。

しかし、セラミド類は結晶性が高い高融点化合物であり、またその特異的な両親媒性構造により殆どの油溶性あるいは水溶性化粧品基剤 (溶媒) に対して著しく溶解性が低く、このため従来処方化が困難であるという問題があった。すなわち、セラミド類を製品中に多量に配合すると結晶が析出し、製品の安定性に支障をきたしたり、またセラミドをより多く溶解させるために油剤を用いると、その油剤によっては安全性上好ましくなかったりする場合があった。

### 【0003】

一方、近年セラミド類を化粧品や医薬品などに応用する場合、セラミド類を透明な溶液状組成物として提供することが望まれている。これに対処するため、例えば特開平9-315929号公報では、スフィンゴ脂質、リゾリン脂質、多価アルコールからなり、スフィンゴ脂質とリゾリン脂質の配合比が2/1以下である透明な脂質組成物が提案されている。しかし、この組成物は水が配合されていない無水の混合物の状態である。また特表平9-505065号公報では、フィトスフィンゴシン含有セラミドがC<sub>6</sub>~100のエステルベース中に安定に懸濁し、C<sub>8</sub>~22モノ脂肪酸エステルに可溶化した脂質組成物が提案されている。しかし、この組成物も無水の組成物が好ましいものである。つまり、両者とも最終製品製造に際し多用される水を加えた場合、透明な状態を保つこと、また水により任意に希釈して透明な製剤を調製することは困難であった。

また、特許第3008212号公報では、(A)両親媒性脂質、(B)非イオン性界面活性剤、(C)イオン性界面活性剤、(D)水性媒体からなり、(A)



／〔(B) + (C)〕 = 0.2～1.0である透明ないし半透明の化粧料が提案されている。しかし、実際に用いている両親媒性脂質は疑似セラミドであり、化粧品の使用に好まれていないイオン性界面活性剤を用いているために、これに起因する皮膚刺激が懸念されるという問題があった。

【0004】

【発明が解決しようとする課題】

本発明は、上記の如き問題点のない、水との相溶性に優れた透明な水性組成物であって、しかもセラミド類を高濃度で含有し、かつイオン性界面活性剤を用いる必要のない水性組成物を提供することにある。

すなわち、本発明の目的は、セラミド類を高濃度で含有する、透明で、かつ安定性、安全性に優れた水性組成物を提供することである。

また、本発明の他の目的は、水により任意に希釈しても透明な状態を保つことを可能とする水性透明組成物を提供することである。

また、本発明の他の目的は、セラミド類を含有し、安定性、安全性、使用感に優れた化粧品や医薬品の製造に容易に応用することができる水性透明組成物を提供することである。

また、本発明の他の目的は、上記水性透明組成物の調製方法を提供することである。

また、本発明の他の目的は、上記水性透明組成物を含有する皮膚化粧料を提供することである。

また、本発明の他の目的は、上記水性透明組成物を含有する毛髪用化粧料を提供することである。

また、本発明の他の目的は、上記水性透明組成物を含有する浴用剤を提供することである。

さらに、本発明の他の目的は、上記水性透明組成物を調製するために有用な脂質組成物を提供することである。

【0005】

【課題を解決するための手段】

上記課題を解決するため本発明者らは鋭意検討を重ねた結果、セラミド類、炭

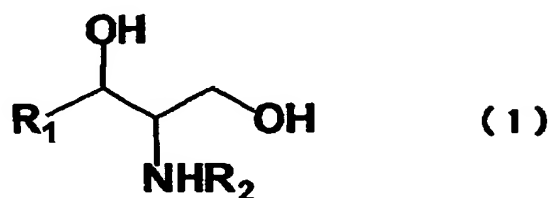
素数 12～24 の長鎖脂肪酸、非イオン界面活性剤を成分とする脂質組成物が水との相溶性に優れるとの知見を得、その知見に基づきさらに検討した結果、この脂質組成物から、組成物中にセラミド類を 1.0～5.0 重量%含有する、安定性、安全性に優れた水性透明組成物を得ることができ、更に上記脂質組成物および水性透明組成物は、透明な状態を保ったまま水により任意に希釈することが可能であることを見出し本発明を完成するに至った。

【0006】

すなわち、本発明は、

(1) (A) 式 1 :

【化 5】



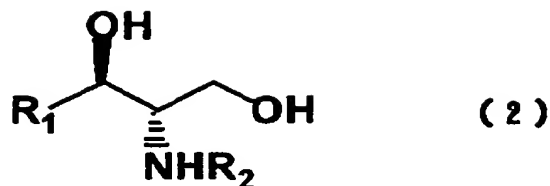
(式中、 $R_1$  は炭素数 9～17 の炭化水素基を表し、 $R_2$  は炭素数 2～30 の水酸基を有してもよいアシル基を表す。)

で表されるセラミド類、(B) 炭素数 12～24 の長鎖脂肪酸、(C) 非イオン界面活性剤および (D) 水からなり、上記式 1 で表されるセラミド類を 1.0～5.0 重量%含有することを特徴とする水性透明組成物、

【0007】

(2) 上記セラミド類が、式 2 :

【化6】



(式中、 $\text{R}_1$  および  $\text{R}_2$  は上記と同じものを表す。)

で表される光学活性な天然型セラミド類であることを特徴とする上記(1)記載の水性透明組成物、

【0008】

(3) 上記長鎖脂肪酸がイソステアリン酸およびオレイン酸から選ばれた少なくとも1種であることを特徴とする上記(1)または(2)記載の水性透明組成物、

(4) 上記非イオン界面活性剤がポリオキシエチレン硬化ヒマシ油類であることを特徴とする上記(1)～(3)のいずれかに記載の水性透明組成物、

【0009】

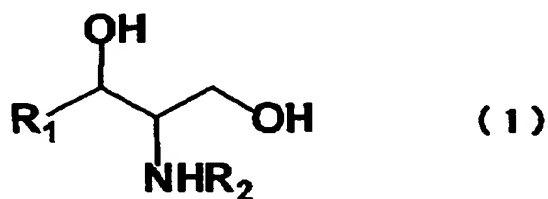
(5) ステロール類または多価アルコール類からなる群から選ばれた少なくとも一種の化合物がさらに配合されていることを特徴とする上記(1)～(4)のいずれかに記載の水性透明組成物、

(6) 上記ステロール類がコレステロールである上記(5)記載の水性透明組成物、

【0010】

(7) (A) 式1：

【化 7】



(式中、 $\text{R}_1$  および  $\text{R}_2$  は上記と同じものを表す。)

で表されるセラミド類、(B) 炭素数 12～24 の長鎖脂肪酸、および (C) 非イオン界面活性剤を含む脂質組成物に水を加えることを特徴とする、式 1 で表されるセラミド類を 1.0～5.0 重量%含有する水性透明組成物の調製方法、

【0011】

(8) 上記水性透明組成物を 0.01～100 重量%含有することを特徴とする皮膚化粧料、

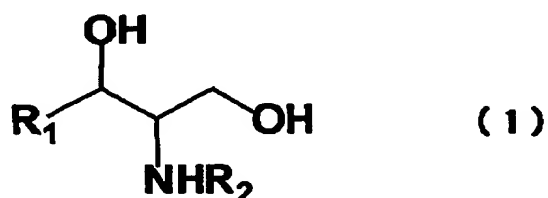
(9) 上記水性透明組成物を 0.01～50 重量%含有することを特徴とする毛髪化粧料、

(10) 上記水性透明組成物を 0.001～50 重量%含有することを特徴とする浴用剤、

【0012】

(11) (A) 式 1 :

【化 8】



(式中、 $\text{R}_1$  および  $\text{R}_2$  は上記と同じものを表す。)

で表されるセラミド類、(B) 炭素数 12～24 の長鎖脂肪酸、および (C) 非

イオン界面活性剤を含み、上記セラミド類（A）と上記長鎖脂肪酸（B）の重量比がA：B＝20：1～1：3であり、上記セラミド類（A）と非イオン界面活性剤（C）の重量比がA：C＝1：1～1：10であることを特徴とする水性透明組成物を調製するために有用な脂質組成物、  
を提供する。

【0013】

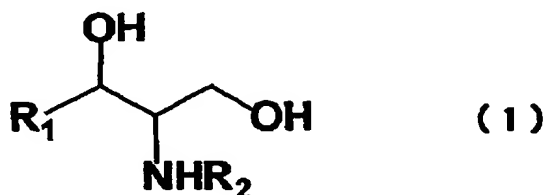
【発明の実施の形態】

以下、本発明を詳しく説明する。

本発明の水性透明組成物を構成する成分Aは、下式1で表されるセラミド類である。

【0014】

【化9】



（式中、R<sub>1</sub> およびR<sub>2</sub> は上記と同じものを表す。）

【0015】

上記式1で表される化合物は公知の化合物であり、ヒトや豚の皮膚、牛の脳、赤血球など哺乳動物抽出物や大豆、小麦等の植物抽出物から得ることが可能であるが、公知の製法（例えば、特開平7-165690号公報、Shapiro et.al., J .Am.Chem.Soc., 80, 2170 ('58)など）により得られる合成品が純度面から好適である。

【0016】

上記式1中、R<sub>1</sub> は炭素数9～17の炭化水素基を表し、具体的には、ノナニル、デカニル、ウンデカニル、ドデカニル、トリデカニル、テトラデカニル、ペンタデカニル、ヘキサデカニル、ヘプタデカニルなどであり、R<sub>1</sub> として好まし

い基は、ウンデカニル、ドデカニル、トリデカニル、テトラデカニル、ペンタデカニル、ヘキサデカニル、ヘプタデカニルなどである。また、 $R_2$  は炭素数 2 ～ 30 の水酸基を有していてもよいアシル基を表し、具体的には、アセチル、プロパノイル、ブタノイル、ペンタノイル、ヘキサノイル、ヘプタノイル、オクタノイル、ノナノイル、デカノイル、ウンデカノイル、ドデカノイル、トリデカノイル、テトラデカノイル、ペンタデカノイル、ヘキサデカノイル、ヘプタデカノイル、オクタデカノイル、オレオイル、リノレオイル、リノレンオイル、ノナデカノイル、イコサノイル、ヘンエイコサノイル、ドコサノイル、トリコサノイル、テトラコサノイル、ペンタコサノイル、ヘキサコサノイル、ヘプタコサノイル、オクタコサノイル、ノナコサノイル、トリアコンタノイル、2-ヒドロキシアセチル、2-ヒドロキシプロパノイル、2-ヒドロキシブタノイル、2-ヒドロキシペンタノイル、2-ヒドロキシヘキサノイル、2-ヒドロキシヘプタノイル、2-ヒドロキシオクタノイル、2-ヒドロキシノナノイル、2-ヒドロキシデカノイル、2-ヒドロキシウンデカノイル、2-ヒドロキシドデカノイル、2-ヒドロキシトリデカノイル、2-ヒドロキシテトラデカノイル、2-ヒドロキシペンタデカノイル、2-ヒドロキシヘキサデカノイル、2-ヒドロキシヘプタデカノイル、2-ヒドロキシオクタデカノイル、2-ヒドロキシノナデカノイル、2-ヒドロキシイコサノイル、2-ヒドロキシヘンエイコサノイル、2-ヒドロキシドコサノイル、2-ヒドロキシトリコサノイル、2-ヒドロキシテトラコサノイル、2-ヒドロキシペンタコサノイル、2-ヒドロキシヘキサコサノイル、2-ヒドロキシヘプタコサノイル、2-ヒドロキシオクタコサノイル、2-ヒドロキシノナコサノイル、2-ヒドロキシトリアコンタノイル、3-ヒドロキシプロパノイル、3-ヒドロキシブタノイル、3-ヒドロキシペンタノイル、3-ヒドロキシヘキサノイル、3-ヒドロキシヘプタノイル、3-ヒドロキシオクタノイル、3-ヒドロキシノナノイル、3-ヒドロキシデカノイル、3-ヒドロキシウンデカノイル、3-ヒドロキシドデカノイル、3-ヒドロキシトリデカノイル、3-ヒドロキシテトラデカノイル、3-ヒドロキシペンタデカノイル、3-ヒドロキシヘキサデカノイル、3-ヒドロキシヘプタデカノイル、3-ヒドロキシオクタデカノイル、3-ヒドロキシノナデカノイル、3-ヒドロキシイコサノイル

、3-ヒドロキシヘンエイコサノイル、3-ヒドロキシドコサノイル、3-ヒドロキシトリコサノイル、3-ヒドロキシテトラコサノイル、3-ヒドロキシペンタコサノイル、3-ヒドロキシヘキサコサノイル、3-ヒドロキシヘプタコサノイル、3-ヒドロキシオクタコサノイル、3-ヒドロキシノナコサノイル、3-ヒドロキシトリアコンタノイルなどであり、好ましい $R_2$ は、炭素数14～30の水酸基を有していてもよいアシル基であり、具体的には、テトラデカノイル、ペンタデカノイル、ヘキサデカノイル、ヘプタデカノイル、オクタデカノイル、オレオイル、リノレオイル、リノレンオイル、ノナデカノイル、イコサノイル、ヘンエイコサノイル、ドコサノイル、トリコサノイル、テトラコサノイル、ペンタコサノイル、ヘキサコサノイル、ヘプタコサノイル、オクタコサノイル、ノナコサノイル、トリアコンタノイル、2-ヒドロキシテトラデカノイル、2-ヒドロキシペンタデカノイル、2-ヒドロキシヘキサデカノイル、2-ヒドロキシヘプタデカノイル、2-ヒドロキシオクタデカノイル、2-ヒドロキシノナデカノイル、2-ヒドロキシイコサノイル、2-ヒドロキシヘンエイコサノイル、2-ヒドロキシドコサノイル、2-ヒドロキシトリコサノイル、2-ヒドロキシテトラコサノイル、2-ヒドロキシペンタコサノイル、2-ヒドロキシヘキサコサノイル、2-ヒドロキシヘプタコサノイル、2-ヒドロキシオクタコサノイル、2-ヒドロキシノナコサノイル、2-ヒドロキシトリアコンタノイル、3-ヒドロキシテトラデカノイル、3-ヒドロキシペンタデカノイル、3-ヒドロキシヘキサデカノイル、3-ヒドロキシヘプタデカノイル、3-ヒドロキシオクタデカノイル、3-ヒドロキシノナデカノイル、3-ヒドロキシイコサノイル、3-ヒドロキシヘンエイコサノイル、3-ヒドロキシドコサノイル、3-ヒドロキシトリコサノイル、3-ヒドロキシテトラコサノイル、3-ヒドロキシペンタコサノイル、3-ヒドロキシヘキサコサノイル、3-ヒドロキシヘプタコサノイル、3-ヒドロキシオクタコサノイル、3-ヒドロキシノナコサノイル、3-ヒドロキシトリアコンタノイルなどであり、 $R_2$ としてより好ましい基は、テトラデカノイル、ペンタデカノイル、ヘキサデカノイル、ヘプタデカノイル、オクタデカノイル、ノナデカノイル、イコサノイル、ヘンエイコサノイル、ドコサノイル、トリコサノイル、テトラコサノイルなどのアシル基、それらの一部の水素原子が水酸

基で置換されたものがある。水酸基を含むアシル基のなかでは、特に2-ヒドロキシヘキサデカノイルがより好ましい。

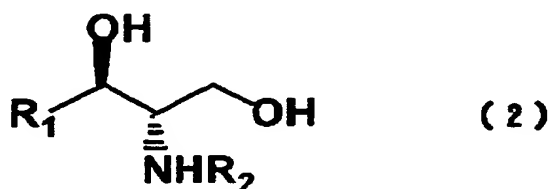
## 【0017】

式1で表される具体的な化合物の例としては、2-テトラデカノイルアミノオクタデカン-1, 3-ジオール、2-ヘキサデカノイルアミノオクタデカン-1, 3-ジオール、2-オクタデカノイルアミノオクタデカン-1, 3-ジオール、2-エイコサノイルアミノオクタデカン-1, 3-ジオール、2-オレオイルアミノオクタデカン-1, 3-ジオール、2-リノレオイルアミノオクタデカン-1, 3-ジオール、2-(2-ヒドロキシヘキサデカノイル)アミノオクタデカン-1, 3-ジオール、2-(3-ヒドロキシヘキサデカノイル)アミノオクタデカン-1, 3-ジオール、2-テトラデカノイルアミノヘキサデカン-1, 3-ジオール、2-ヘキサデカノイルアミノヘキサデカン-1, 3-ジオール、2-オクタデカノイルアミノヘキサデカン-1, 3-ジオール、2-エイコサノイルアミノヘキサデカン-1, 3-ジオール、2-オレオイルアミノヘキサデカン-1, 3-ジオール、2-リノレオイルアミノヘキサデカン-1, 3-ジオール、2-(2-ヒドロキシヘキサデカノイル)アミノヘキサデカン-1, 3-ジオールなどが挙げられる。しかし、本発明で用いられるセラミド類がこれら具体的に例示されたものに限定されるわけではない。

## 【0018】

式1で表される化合物のなかでは、特に、式2：

## 【化10】



(式中、 $\text{R}_1$  および  $\text{R}_2$  は上記と同じものを表す。)

で表される光学活性な天然型セラミド類が好ましいものである。この光学活性な



天然型セラミド類における好ましい $R_1$ および $R_2$ は、式1の $R_1$ および $R_2$ で好ましいとされた基と同様のものである。

### 【0019】

式2で表される化合物の例を具体的にあげると、(2S, 3R)-2-テトラデカノイルアミノオクタデカン-1, 3-ジオール、(2S, 3R)-2-ヘキサデカノイルアミノオクタデカン-1, 3-ジオール、(2S, 3R)-2-オクタデカノイルアミノオクタデカン-1, 3-ジオール、(2S, 3R)-2-ノナデカノイルアミノオクタデカン-1, 3-ジオール、(2S, 3R)-2-エイコサノイルアミノオクタデカン-1, 3-ジオール、(2S, 3R)-2-オレオイルアミノオクタデカン-1, 3-ジオール、(2S, 3R)-2-リノレオイルアミノオクタデカン-1, 3-ジオール、(2S, 3R)-2-(2-ヒドロキシヘキサデカノイル)アミノオクタデカン-1, 3-ジオール、(2S, 3R)-2-(3-ヒドロキシヘキサデカノイル)アミノオクタデカン-1, 3-ジオール、(2S, 3R)-2-テトラデカノイルアミノヘキサデカン-1, 3-ジオール、(2S, 3R)-2-ヘキサデカノイルアミノヘキサデカン-1, 3-ジオール、(2S, 3R)-2-オクタデカノイルアミノヘキサデカン-1, 3-ジオール、(2S, 3R)-2-ノナデカノイルアミノヘキサデカン-1, 3-ジオール、(2S, 3R)-2-エイコサノイルアミノヘキサデカン-1, 3-ジオール、(2S, 3R)-2-オレオイルアミノヘキサデカン-1, 3-ジオール、(2S, 3R)-2-リノレオイルアミノヘキサデカン-1, 3-ジオール、(2S, 3R)-2-(2-ヒドロキシヘキサデカノイル)アミノヘキサデカン-1, 3-ジオール等であり、これらは単独でまたは2種以上を組み合わせる用いることができる。なお、上記式2で表される光学活性な天然型セラミド類が、これら具体的に例示された化合物に限定されないことは言うまでもないことである。

### 【0020】

この式2で表される化合物も公知の化合物であり、公知の製法(例えば、特開平9-235259号公報、特開平6-80617号公報など)により調製することができる。

## 【 0 0 2 1 】

また、本発明の水性透明組成物を構成する成分Bである炭素数12～24の長鎖脂肪酸としては、例えば、ラウリン酸、ミリスチン酸、パルミチン酸、ステアリン酸、オレイン酸、12-ヒドロキシステアリン酸、ウンデシレン酸、トール酸、イソステアリン酸、リノール酸、リノレイン酸、エイコサペンタエン酸（EPA）、ドコサヘキサエン酸（DHA）等があげられ、これらは単独でまたは2種以上を組み合わせる用いることができる。これらの中で好ましいものはイソステアリン酸およびオレイン酸であり、特に好ましいものはイソステアリン酸である。これら長鎖脂肪酸はすでに公知の化合物であり、市販もされている。

## 【 0 0 2 2 】

さらに、本発明の水性透明組成物を構成する成分Cである非イオン界面活性剤としては、親水性非イオン界面活性剤あるいは親油性非イオン界面活性剤をあげることができる。

親油性非イオン界面活性剤としては、例えば、ソルビタンモノオレエート、ソルビタンモノイソステアレート、ソルビタンモノラウレート、ソルビタンモノパルミテート、ソルビタンモノステアレート、ソルビタンセスキオレエート、ソルビタントリオレエート、ペンター2-エチルヘキシル酸ジグリセロールソルビタン、テトラ-2-エチルヘキシル酸ジグリセロールソルビタン等のソルビタン脂肪酸エステル類；モノ綿実油脂肪酸グリセリン、モノエルカ酸グリセリン、セスキオレイン酸グリセリン、モノステアリン酸グリセリン、 $\alpha$ ， $\alpha'$ -オレイン酸ピログルタミン酸グリセリン、モノイソステアリン酸グリセリン等のポリグリセリン脂肪酸類；モノステアリン酸プロピレングリコール等のプロピレングリコール脂肪酸エステル類；硬化ヒマシ油誘導体、グリセリンアルキルエーテル等が挙げられる。

## 【 0 0 2 3 】

また、親水性非イオン界面活性剤としては、例えば、ポリオキシエチレン（以下「POE」という。）ソルビタンモノオレエート、POE-ソルビタンモノステアレート、POE-ソルビタンモノオレエート、POE-ソルビタンテトラオレエート等のPOEソルビタン脂肪酸エステル類；POE-ソルビットモノラウレ

ート、POE-ソルビットモノオレエート、POE-ソルビットペンタオレエート、POE-ソルビットモノステアレート等のPOEソルビット脂肪酸エステル類；POE-グリセリンモノステアレート、POE-グリセリンモノイソステアレート、POE-グリセリントリイソステアレート等のPOEグリセリン脂肪酸エステル類；POEモノオレエート、POEジステアレート、POEモノジオレエート、ステアリン酸エチレングリコール等のPOE脂肪酸エステル類；POEラウリルエーテル、POEオレイルエーテル、POEステアリルエーテル、POEベヘニルエーテル、POE2-オクチルドデシルエーテル、POEコレスタノールエーテル等のPOEアルキルエーテル類；POEオクチルフェニルエーテル、POEノニルフェニルエーテル、POEジノニルフェニルエーテル等のPOEアルキルフェニルエーテル類；POE・ポリオキシプロピレン（以下「POP」という。）セチルエーテル、POE・POP2-デシルテトラデシルエーテル、POE・POPモノブチルエーテル、POE・POP水添ラノリン、POE・POPグリセリンエーテル等のPOE・POPアルキルエーテル類；テトロニック等のテトラPOE・テトラPOPエチレンジアミン縮合物類；POEヒマシ油、POE硬化ヒマシ油、POE硬化ヒマシ油モノイソステアレート、POE硬化ヒマシ油トリイソステアレート、POE硬化ヒマシ油モノピログルタミン酸モノイソステアリン酸ジエステル、POE硬化ヒマシ油マレイン酸等のPOEヒマシ油あるいは硬化ヒマシ油誘導体；POEソルビットミツロウ等のPOEミツロウ・ラノリン誘導体；ヤシ油脂肪酸ジエタノールアミド、ラウリン酸モノエタノールアミド、脂肪酸イソプロパノールアミド等のアルカノールアミド；POEプロピレングリコール脂肪酸エステル、POEアルキルアミン、POE脂肪酸アミド、ショ糖脂肪酸エステル、POEノニルフェニルホルムアルデヒド縮合物、アルキルエトキシジメチルアミンオキシド、トリオレイルリン酸等を挙げることができる。

これら非イオン界面活性剤は、単独でまたは2種以上を組み合わせ用いることができる。また、非イオン界面活性剤としては、特にPOE硬化ヒマシ油誘導体、POEヒマシ油誘導体が安定性、安全性面から好ましい。

上記非イオン界面活性剤自体すでに公知のものであり、市販もされている。

## 【 0 0 2 4 】

さらに、本発明の水溶性透明組成物を構成する成分Dの水としては、公知の方法で精製された水を用いることが好ましい。

## 【 0 0 2 5 】

本発明のセラミド類を1.0～5.0重量%含有する水性透明組成物において、セラミド類(A)と長鎖脂肪酸(B)の重量比は、 $A : B = 20 : 1 \sim 1 : 3$ が好ましい。成分Aに対する成分Bの重量比が5%未満であると、製剤の透明である温度領域が狭くなる傾向があり、一方3倍量を超えた場合には系が不安定になり保存安定性も悪くなる傾向がある。また、セラミド類(A)と非イオン界面活性剤(C)の重量比は、 $A : C = 1 : 1 \sim 1 : 10$ が好ましい。成分Aに対する成分Cの重量比が等量未満であると、化粧品等製剤とした場合の製剤の透明である温度領域が狭くなる傾向があり、一方10倍量を超えた場合系の安定性に変わりがないので不経済であるうえ、化粧品等の製剤ののびが重くなり、べたつく等使用感に悪影響を与える場合がある。

## 【 0 0 2 6 】

本発明の水溶性透明組成物では、さらに(E)ステロール類および(F)多価アルコール類からなる群から選ばれた少なくとも一種の化合物が配合されていてもよい。

## 【 0 0 2 7 】

上記ステロール類としては、ステロイド骨格を有するアルコールであれば特に制限はない。本発明において用いられるステロール類の例としては、例えばコレステロール、ジヒドロコレステロール、ラノステロール、ジヒドロラノステロール、シトステロール、エルゴステロールなどが挙げられ、コレステロールが好ましいものである。

## 【 0 0 2 8 】

また、上記多価アルコール類としては、例えば、エチレングリコール、プロピレングリコール、トリメチレングリコール、イソプロレングリコール、1, 2-ブチレングリコール、1, 3-ブチレングリコール、テトラメチレングリコール、2, 3-ブチレングリコール、ペンタメチレングリコール、2-ブテン-1, 4

ージオール、ヘキシレングリコール、オクチレングリコール等の2価のアルコール；グリセリン、トリメチロールプロパン、1, 2, 6-ヘキサントリオール等の3価のアルコール；ペンタエリスリトール等の4価アルコール；キシリトール等の5価アルコール；ソルビトール、マンニトール等の6価アルコール；ジエチレングリコール、ジプロピレングリコール、トリエチレングリコール、ポリプロピレングリコール、テトラエチレングリコール、ジグリセリン、ポリエチレングリコール、トリグリセリン、テトラグリセリン、ポリグリセリン等の多価アルコール重合体；エチレングリコールモノメチルエーテル、エチレングリコールモノエチルエーテル、エチレングリコールモノブチルエーテル、エチレングリコールモノフェニルエーテル、エチレングリコールモノヘキシルエーテル、エチレングリコールモノ2-メチルヘキシルエーテル、エチレングリコールイソアミルエーテル、エチレングリコールベンジルエーテル、エチレングリコールイソプロピルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル、エチレングリコールジエチルエーテル、エチレングリコールジブチルエーテル等のエチレングリコールアルキルエーテル類；ジエチレングリコールモノメチルエーテル、ジエチレングリコールモノエチルエーテル、ジエチレングリコールモノブチルエーテル、ジエチレングリコールジメチルエーテル、ジエチレングリコールジエチルエーテル、ジエチレングリコールジブチルエーテル、ジエチレングリコールメチルエチルエーテル、トリエチレングリコールモノメチルエーテル、トリエチレングリコールモノエチルエーテル等のエチレングリコール重合体アルキルエーテル類；プロピレングリコールモノメチルエーテル、プロピレングリコールモノエチルエーテル、プロピレングリコールモノブチルエーテル、プロピレングリコールイソプロピルエーテル等のプロピレングリコールアルキルエーテル類；ジプロピレングリコールメチルエーテル、ジプロピレングリコールエチルエーテル、ジプロピレングリコールブチルエーテル等のジプロピレングリコールアルキルエーテル類；エチレングリコールモノメチルエーテルアセテート、エチレングリコールモノエチルエーテルアセテート、エチレングリコールモノブチルエーテルアセテート、エチレングリコールモノフェニルエーテルアセテート、ジエチレングリコールモノエチルエーテルアセテート、ジエチレングリコールモノブチルエーテルアセテート、プロピ

レングリコールモノメチルエーテルアセテート、プロピレングリコールモノエチルエーテルアセテート、プロピレングリコールモノプロピルエーテルアセテート、プロピレングリコールモノフェニルエーテルアセテート等の2価アルコールエーテルエステル；キシルアルコール、セラキルアルコール、パチルアルコール等のグリセリンモノアルキルエーテル；エチレングリコールジアジベート、エチレングリコールジサクシネート等の2価アルコールジエステル；ソルビトール、マルチトール、マルトトリオース、マンニトール、ショ糖、エリトリトール、グルコース、フルクトース、デンプン分解糖、マルトース、キシリトース、デンプン分解糖還元アルコール等の糖アルコール；グリソリッド、テトラヒドロフルフリルアルコール、POEテトラヒドロフルフリルアルコール、POPブチルエーテル、POP・POEブチルエーテル、トリポリオキシプロピレングリセリンエーテル、POPグリセリンエーテル、POPグリセリンエーテルリン酸、POP・POEペンタンエリスリトールエーテル等が挙げられる。これら多価アルコール類は、単独でまたは2種以上を組み合わせる用いることができる。多価アルコール類としては、特に1，3-ブチレングリコール、グリセリンが好ましい。

#### 【0029】

本発明の水性透明組成物には、さらに（G）アニオン界面活性剤が配合されていてもよい。上記アニオン界面活性剤としては、例えば、セッケン用素地、ラウリン酸ナトリウム、パルミチン酸ナトリウム等の脂肪酸セッケン；ラウリル硫酸ナトリウム、ラウリル硫酸カリウム等の高級アルキル硫酸エステル塩；POEラウリル硫酸トリエタノールアミン、POEラウリル硫酸ナトリウム等のアルキルエーテル硫酸エステル塩；ラウロイルサルコシンナトリウム等のN-アシルサルコシン酸塩；N-ミリストイル-N-メチルタウリンナトリウム、ヤシ油脂肪酸メチルタウリッドナトリウム、ラウリルメチルタウリッドナトリウム等の高級脂肪酸アミドスルホン酸塩；POEオレイルエーテルリン酸ナトリウム、POEステアリルエーテルリン酸等のリン酸エステル塩；ジ-2-エチルヘキシルスルホコハク酸ナトリウム、モノラウロイルモノエタノールアミドポリオキシエチレンスルホコハク酸ナトリウム、ラウリルポリプロピレングリコールスルホコハク酸ナトリウム等のスルホコハク酸塩；リニアドデシルベンゼンスルホン酸ナトリウ

ム、リニアドデシルベンゼンスルホン酸トリエタノールアミン等のアルキルベンゼンスルホン酸塩；N-ラウロイルグルタミン酸モノナトリウム、N-ステアロイルグルタミン酸ジナトリウム、N-ミリストイル-L-グルタミン酸モノナトリウム等のN-アシルグルタミン酸塩；硬化ヤシ油脂肪酸グリセリン硫酸ナトリウム等の高級脂肪酸エステル硫酸エステル塩；ロート油等の硫酸化油、POEアルキルエーテルカルボン酸、POEアルキルアリルエーテルカルボン酸塩、 $\alpha$ -オレフィンスルホン酸塩、高級脂肪酸エステルスルホン酸塩、二級アルコール硫酸エステル塩、高級脂肪酸アルキロールアミド硫酸エステル塩、ラウロイルモノエタノールアミドコハク酸ナトリウム、N-パルミトイルアスパラギン酸ジトリエタノールアミン、カゼインナトリウム等が挙げられる。

これらのアニオン界面活性剤は、単独でまたは2種以上を組み合わせる用いることができる。また、アニオン界面活性剤としては、特にPOEリン酸エステル塩類、POEアルキルアリルエーテルカルボン酸塩類が安定性、安全性面から好ましい。

#### 【0030】

上記追加分成分として使用されるステロール類(E)、及び多価アルコール類(F)、及びアニオン界面活性剤(G)の配合量は、他の構成成分との関係から任意であり特に限定されないが、ステロール類(E)はセラミド類(A)に対して0.001~3倍量が好ましく、多価アルコール類(F)は全組成中0.1~70重量%が好ましく、更にアニオン界面活性剤(G)は製剤の全組成中0.001~20%が好ましい。

#### 【0031】

以下、本発明の水性透明組成物の調製方法について説明する。

本発明の水性透明組成物は、上述した成分であるセラミド類(A)、長鎖脂肪酸(B)および非イオン界面活性剤(C)からなり、さらに必要に応じてステロール類(E)および多価アルコール類(F)からなる群から選ばれた少なくとも一種を追加した脂質組成物と水を配合することにより得られるが、より好適には予め脂質混合物を加熱溶解しておき、そこに予め加温した水を加えた後、室温に戻すことにより得ることができる。より好ましくは、予め成分A、B、C及び必

要に応じて成分Eからなる脂質混合物を加熱溶解しておき、そこに予め同程度の温度に加温した多価アルコール類（F）を加え、最後に予め同程度の温度に加温した水を加えた後室温に戻すことにより安定性、使用感に優れた透明な組成物を得ることができる。

## 【0032】

本発明では上記各成分のなかで、長鎖脂肪酸として、特にイソステアリン酸あるいはオレイン酸またはその両者を選び、非イオン界面活性剤として、特にPOE硬化ヒマシ油類、POEヒマシ油類、POEソルビタン脂肪酸エステル類からなる群から選ばれた少なくとも一種を選び、これらの混合物と上記セラミド類とから形成された脂質組成物と水を共存させてなる水性組成物は、透明が維持されているうえ、使用感も特に優れたものである。さらに、上記脂質組成物にアニオン界面活性剤、ステロール類および多価アルコール類からなる群から選ばれた少なくとも一種の化合物がさらに配合されて得られた脂質組成物に水を共存させてなる水性組成物は、透明性や使用感に優れた組成物である。なお、このとき、ステロール類としてはコレステロールが、多価アルコールとしては、1，3-ブチレングルコールおよびグリセリンが好ましいものである。

## 【0033】

また、本発明のセラミド類を1.0～5.0重量%含有する水性透明組成物を調製するために用いられる脂質組成物としては、（A）上記式1で表されるセラミド類、（B）炭素数12～24の長鎖脂肪酸および（C）非イオン界面活性剤を含み、上記セラミド類（A）と上記長鎖脂肪酸（B）の重量比が $A : B = 20 : 1 \sim 1 : 3$ であり、上記セラミド類（A）と非イオン界面活性剤（C）の重量比が $A : C = 1 : 1 \sim 1 : 10$ である脂質組成物が好ましいものである。

## 【0034】

本発明の水性透明組成物には、上記セラミド類、長鎖脂肪酸、非イオン界面活性剤、水、アニオン界面活性剤、ステロール類、多価アルコール等の構成成分の他に、通常化粧品や皮膚外用剤とくに医療用皮膚外用剤または浴用剤などに用いられる他の成分、例えば、粉末成分、液体油脂、固体油脂、ロウ、炭化水素、高級アルコール、エステル類、シリコン、カチオン界面活性剤、両性界面活性剤



、保湿剤、水溶性高分子化合物、増粘剤、皮膜剤、紫外線吸収剤、金属イオン封鎖剤、低級アルコール、糖類、アミノ酸類、有機アミン類、合成樹脂エマルジョン、pH調整剤、皮膚栄養剤、ビタミン類、酸化防止剤、酸化防止助剤、香料、水等を必要に応じて適宜配合することができる。

【 0 0 3 5 】

本発明の水性透明組成物はセラミド類を高濃度に含有するものであるから、例えば眼瞼防止用美容液、皮膚外用剤、皮膚保護剤、とくに医療用皮膚外用剤や医療用皮膚保護剤等の医薬品などとしてそのまま使用することができる。また、本発明の水性透明組成物は、化粧料、浴用剤、毛髪用化粧料、皮膚外用剤、皮膚保護剤、とくに医療用皮膚外用剤や医療用皮膚保護剤等の医薬品の成分材料として使用することができる。また、本発明の水性透明組成物は、常法により種々の形態に調製することができる。例えば、透明なローション状、有機溶媒による透明な溶液状等にすることができる。なお、当然のことながらクリーム状、ゲル状、乳液状等にすることもできる。

【 0 0 3 6 】

【実施例】

以下、実施例および比較例を挙げて本発明を更に具体的に説明するが、本発明はこれらの例により制限されるものではない。

【 0 0 3 7 】

実施例 1 ～ 5

表 1 記載の成分を表 1 記載の量だけ秤取り、下記手順により水性透明組成物を調製した。

なお、以下において配合量は特に記載がない限り重量％であり、また表中、光学活性セラミド 2 は、(2S, 3R) - 2 - オクタデカノイルアミノオクタデカン - 1, 3 - ジオールを、光学活性セラミド 5 は、(2S, 3R) - 2 - (2 - ヒドロキシヘキサデカノイル) アミノオクタデカン - 1, 3 - ジオールを、ラセミ体セラミド 2 は、2 - オクタデカノイルアミノオクタデカン - 1, 3 - ジオールをそれぞれ表す。

【 0 0 3 8 】

## 組成物の調製手順：

表 1 中の成分 1～6 を 8 0～1 2 0℃にて均一に加熱混合し、予め 8 0～1 2 0℃にて加熱しておいた成分 7～8 を添加し加熱混合する。得られた脂質組成物に、8 0～1 0 0℃に加熱しておいた成分 9（精製水）を徐々に加え、加熱混合し、組成物を得る。

## 【0 0 3 9】

調製された組成物の外観評価を下記の外観評価試験にしたがって行った。結果を表 1 に示す。

## 外観評価試験：

水性組成物を調製後、室温で 1 カ月、4 0℃で 2 週間、5℃で 2 週間放置後、目視により外観を評価した。評価は、下記の評価基準にしたがった。

- ◎ 透明
- ほぼ透明
- △ やや白濁
- ▲ 白濁
- × 溶解せず

## 【0 0 4 0】

【表 1】

表 1

成 分	実施例 1	実施例 2	実施例 3	実施例 4	実施例 5
1. 光学活性セラミド 2	1. 50	3. 00	1. 00	1. 00	1. 00
2. イソステアリン酸	1. 50	2. 00	1. 00	-	0. 50
3. オレイン酸	-	-	-	0. 50	-
4. コレステロール	-	-	-	-	0. 50
5. POE(60)硬化ヒマシ油	8. 00	15. 00	5. 00	5. 00	3. 25
6. モノオレイン酸POE(20)ソルピタン	-	-	-	-	1. 75
7. 1,3-ブチレングリコール	-	10. 00	10. 00	5. 00	5. 00
8. 濃グリセリン	-	-	-	5. 00	10. 00
9. 精製水	qs	qs	qs	qs	qs
外 観	◎	○	◎	◎	◎

## 【 0 0 4 1 】

表中、化合物の括弧内の数字はエチレンオキサイドの繰返単位数であり、q s は各配合量を合計すると 1 0 0 重量%となるような量を意味する。

## 【 0 0 4 2 】

比較例 1 ～ 3

表 2 記載の成分を表 2 記載の量だけ秤取り、実施例 1 ～ 5 と同様な方法により水性組成物を調製した。

得られた組成物の外観評価試験を実施例 1 ～ 5 と同様な方法により行った。結果を表 2 に示す。

## 【 0 0 4 3 】

【表 2】

表 2

成 分	比較例 1	比較例 2	比較例 3
1. 光学活性セラミド 2	2.00	—	1.00
2. イソステアリン酸	2.00	2.00	1.00
3. オレイン酸	—	—	—
4. コレステロール	—	2.00	—
5. POE(60)硬化ヒマシ油	—	6.00	—
6. モノオレイン酸POE(20) ソルビタン	—	—	—
7. POE(4)ラウリルエーテルリン酸ナトリウム	—	2.00	1.00
8. 水酸化レシチン50%グリセリン溶液	—	—	20.00
9. 1,3-ブチレングリコール	—	10.00	—
10. 濃グリセリン	—	—	20.00
11. 精製水	qs	qs	qs
外 観	×	△	×

## 【 0 0 4 4 】

上記表 1 および表 2 の評価結果から、本発明に係る実施例 1 ～ 5 の組成物が幅広い温度領域で安定性に優れているのに対し、比較例の組成物は安定性が悪く、満足し得る結果が得られないことが分かる。

## 【 0 0 4 5 】

実施例 6 ～ 8、応用例 1

表 3 記載の成分を表 3 記載の量だけ秤取り、実施例 1 ～ 5 と同様な方法により実施例 6 ～ 8 の水性組成物を調製した。

応用例 1 として、アニオン界面活性剤を加えた水性組成物を調製した。

得られた組成物の外観評価試験を実施例 1 ～ 5 と同様な方法により行った。結果を表 3 に示す。

## 【 0 0 4 6 】

【表 3】

表 3

成 分	実施例 6	実施例 7	実施例 8	応用例 1
1. 光学活性セラミド 2	2.00	-	1.00	2.00
2. 光学活性セラミド 5	0.50	2.00	-	-
3. ラセミセラミド 2	-	-	1.00	-
4. イソステアリン酸	2.00	2.00	2.00	2.00
5. コレステロール	2.00	2.00	2.00	2.00
6. POE (60) 硬化ヒマシ油	8.00	6.00	8.00	6.00
7. POE (4) ラウリルエーテルリン酸ナトリウム	-	-	-	2.00
8. 1,3-ブチレングリコール	10.00	10.00	10.00	10.00
9. 精製水	qs	qs	qs	qs
外 観	◎	◎	◎	◎

## 【 0 0 4 7 】

なお、セラミドを含有しない比較例 2 の組成物において白濁化が観測されたが、比較例 2 にセラミドを加えた応用例 1、および実施例 1 ～ 8 において透明な水性組成物が得られたことから、本発明組成物はセラミドを必須成分とする水溶性の脂質複合体が形成されていることが推定される。

## 【 0 0 4 8 】

実施例 9

表 4 記載の成分を表 4 記載の量だけ秤取り、常法に従いローション 100 g を

製造した。

得られたローションの外観評価試験を実施例 1 ～ 5 と同様な方法により行った。  
結果を表 4 に示す。

【 0 0 4 9 】

【表 4】

表 4

成 分	配合量
濃グリセリン	3.00
1,3-ブチレングリコール	5.00
パラオキシ安息香酸エステル	0.20
香料	0.01
実施例 1 の水性透明組成物	10.00
精製水	qs
外 観	◎

【 0 0 5 0 】

実施例 1 0

表 5 記載の成分を表 5 記載の量だけ秤取り、常法に従い美容液 1 0 0 g を製造した。

得られた美容液の外観評価試験を実施例 1 ～ 5 と同様な方法により行った。結果を表 5 に示す。

【 0 0 5 1 】

【表 5】

表 5

成 分	配合量
ヒドロキシエチルセルロース	0.50
濃グリセリン	5.00
1,3-ブチレングリコール	5.00
パラオキシ安息香酸エステル	0.20
香料	0.01
実施例 2 の水性透明組成物	25.00
精製水	qs
外 観	◎

【0 0 5 2】

実施例 1 1

表 6 記載の成分を表 6 記載の量だけ秤取り、常法に従いエモリエントクリーム  
1 0 0 g を製造した。

【0 0 5 3】

【表 6】

表 6

成 分	配合量
硬化油	6.00
ステアリン酸	3.00
セタノール	4.00
スクワラン	2.00
ジカプリン酸ネオペンチルグリコール	8.00
モノステアリン酸ポリオキシエチレンソルビタン(20E. O.)	4.00
親油型モノステアリン酸グリセリン	2.30
ステアロイル-N-メチルタウリンナトリウム	1.70
濃グリセリン	1.00
1,3-ブチレングリコール	7.00
濃グリセリン	3.00
パラオキシ安息香酸エステル	0.25
香料	0.05
実施例1の水性透明組成物	5.00
精製水	qs

【0054】

## 実施例12

表7記載の成分を表7記載の量だけ秤取り、常法に従いエモリエントミルク100gを製造した。

【0055】

【表 7】

表 7

成 分	配合量
ステアリン酸	1.00
イソステアリン酸コレステリル	2.00
ホホバ油	4.00
スクワラン	8.00
セスキオレイン酸ソルビタン	0.80
モノステアリン酸ポリオキシエチレンソルビタン(20E.O.)	1.20
1,3-ブチレングリコール	5.00
パラオキシ安息香酸エステル	0.25
L-アルギニン	0.40
カルボキシビニルポリマー	0.20
香料	0.05
実施例6の水溶性透明組成物	5.00
精製水	qs

【0056】

## 実施例13

表8記載の成分を表8記載の量だけ秤取り、常法に従いコンディショニングサンプル100gを製造した。

【0057】



【表 8】

表 8

成 分	配合量
ポリオキシエチレンラウリルエーテル硫酸ナトリウム	14.00
ラウリン酸アミドプロピルベタイン	4.00
ヤシ油脂肪酸ジエタノールアミド	3.00
カチオン化セルロース	0.50
ジステアリン酸エチレングリコール	1.00
パラオキシ安息香酸エステル	0.25
クエン酸	適量
香料	0.50
実施例 6 の水性透明組成物	5.00
精製水	qs

【 0 0 5 8 】

実施例 1 4

表 9 記載の成分を表 9 記載の量だけ秤取り、常法に従いヘアーリンス 1 0 0 g を製造した。

【 0 0 5 9 】

【表 9】

表 9

成 分	配合量
塩化ステアリルトリメチルアンモニウム	1.00
セタノール	3.00
メチルポリシロキサン	1.00
ポリオキシエチレンステアリルエーテル	1.00
プロピレングリコール	5.00
パラオキシ安息香酸エステル	0.25
水酸化ナトリウム	適量
クエン酸	適量
香料	0.50
実施例 7 の水性透明組成物	5.00
精製水	qs

【 0 0 6 0 】

実施例 1 5

表 1 0 記載の成分を表 1 0 記載の量だけ秤取り、常法に従いヘアーコンディショナー 1 0 0 g を製造した。

【 0 0 6 1 】

【表 1 0】

表 1 0

成 分	配合量
塩化ステアリルトリメチルアンモニウム	0.50
塩化ジステアリルジメチルアンモニウム	1.50
ホホバ油	2.50
セタノール	4.50
液状ラノリン	2.00
ポリオキシエチレンステアリルエーテル	1.50
濃グリセリン	7.00
パラオキシ安息香酸エステル	0.25
水酸化ナトリウム	適量
クエン酸	適量
香料	0.50
実施例 6 の水性透明組成物	5.00
精製水	qs

【 0 0 6 2】

実施例 1 6

表 1 1 記載の成分を表 1 1 記載の量だけ秤取り、常法に従いヘアートニック 1 0 0 g を製造した。

【 0 0 6 3】

【表 1 1】

表 1 1

成 分	配合量
センブリ抽出液	2.00
Ｌ-メントール	0.10
ヒノキチオール	0.01
香料	0.10
パラオキシ安息香酸エステル	0.20
ポリオキシエチレン硬化ヒマシ油	0.50
実施例 4 の水性透明組成物	5.00
精製水	qs

【 0 0 6 4 】

実施例 1 7

表 1 2 記載の成分を表 1 2 記載の量だけ秤取り、常法に従いヘアブローローション 1 0 0 g を製造した。

【 0 0 6 5 】

【表 1 2】

表 1 2

成 分	配合量
ポリオキシエチレンポリオキシプロピレンブチルエーテル	0.50
ポリビニルピロリドン	2.50
塩化ステアリルトリメチルアンモニウム	4.50
ポリエーテル変性シリコン	2.00
パラオキシ安息香酸エステル	0.20
クエン酸	適量
香料	0.10
実施例 3 の水性透明組成物	5.00
精製水	qs

【 0 0 6 6 】

実施例 1 8

表 1 3 記載の成分を表 1 3 記載の量だけ秤取り、常法に従い液体入浴剤 1 0 0 g を製造した。

【 0 0 6 7 】

【表 1 3】

表 1 3

成 分	配合量
ジプロピレングリコール	50.00
1,3-ブチレングリコール	10.00
パラオキシ安息香酸エステル	0.20
香料	1.00
実施例5の水性透明組成物	5.00
精製水	qs

【0068】

## 【発明の効果】

以上詳述したように、本発明のセラミド類含有脂質組成物は水との相溶性に優れており、この脂質組成物から形成されたセラミド類を1.0～5.0重量%含有する水性組成物は、透明ないしほぼ透明であり、安定性、安全性、使用感に優れている。特に、本発明の組成物は、常温で放置された場合に安定であるというだけでなく、高温や低温に放置されていても透明の程度が保持されるという優れた効果を有する。さらに、本発明の組成物は、水により任意に希釈しても透明な状態を保つことができる。

これら優れた効果をもたらす本発明の水性透明組成物は、化粧品、浴用剤、毛髪用化粧品、皮膚外用剤、皮膚保護剤、とくに医療用皮膚外用剤や医療用皮膚保護剤等の医薬品として、あるいはそれらの成分材料として有用であり、また皮膚の保護、治療に有効である。そのなかでもとくに化粧品や医薬品用として有用である。

【書類名】要約書

【要約】

【課題】セラミド類を高濃度で含む、水性透明組成物を得る。

【構成】セラミド類、炭素数 1 2 ～ 2 4 の長鎖脂肪酸および非イオン界面活性剤を含み、必要に応じ更にステロール類および多価アルコール類からなる群から選ばれた少なくとも一種の化合物が配合されている脂質組成物に水を配合して、セラミド類を 1 . 0 ～ 5 . 0 重量%含有する水性透明組成物を得る。この組成物は、化粧品、浴用剤、毛髪用化粧品、皮膚外用剤、皮膚保護剤などに有効に使用することができる。

特 2 0 0 0 - 1 3 8 0 7 2

認定・付加情報

特許出願の番号	特願 2 0 0 0 - 1 3 8 0 7 2
受付番号	5 0 0 0 0 5 7 9 9 9 2
書類名	特許願
担当官	第五担当上席 0 0 9 4
作成日	平成 1 2 年 5 月 1 2 日

<認定情報・付加情報>

【提出日】	平成12年 5月11日
-------	-------------

次頁無



出 願 人 履 歴 情 報

識別番号 [000169466]

1. 変更年月日 1999年 3月 4日  
[変更理由] 住所変更  
住 所 東京都大田区蒲田五丁目37番1号  
氏 名 高砂香料工業株式会社